

Señores

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES

E. S. D.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-084485-00002-0000

Fecha: 2010-10-20 16:39:34 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 10

Re: Expediente N° 10-084.485

Solicitud de Patente de Invención "BIS-PIRIDILPIRIDONAS COMO ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR 1 DE LA HORMONA CONCENTRADORA DE LA MELANINA"

Solicitante: GLAXOSMITHKLINE LLC.

Nuestra Ref: P2010/000087

RESPUESTA AL OFICIO N° 9494 NOTIFICADO

POR FIJACION EN LISTA No. 262 DE FECHA 30 DE JULIO DE 2010,

(EXAMEN DE FORMA ART 12)

CARLOS R. OLARTE, mayor de edad y vecino de Bogotá, identificado tal como aparece al pie de mi firma, en mi carácter de apoderado de la sociedad en referencia, me permito dar respuesta al auto proferido por ese Despacho, dentro del término legal previsto en el artículo 12 del Código Contencioso Administrativo en los siguientes términos:

1. En respuesta a la única observación del Examinador, me permito adjuntar un nuevo Capítulo Reivindicatorio Modificado, en donde se eliminan las Reivindicaciones 24 a 31, y se reenumeran las Reivindicaciones 32 a 34; quedando un total de 26 Reivindicaciones. Así las cosas ajunto un recibo de pago valor de \$114.000.00, que cubre el valor de la tasa de modificación para solicitudes en trámite y un recibo por valor de \$416.000 pagando 16 Reivindicaciones adicionales.
2. Solicito al Despacho sea tenido en cuenta el nuevo pliego de reivindicaciones en el presente trámite.

Atentamente,

CARLOS R. OLARTE
C.C. 79.782.747 de Bogotá
T.P. 74.295

Anexo: Capítulo Reivindicatorio Modificado
Recibo por valor de \$114.000.00 y Recibo por valor de \$416.000.00

2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

IFICACION DE EXCEDENTE : 10 - 88,397
3 : OCTUBRE 20 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-084485- -00002-0000

Fecha: 2010-10-20 16:39:34 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYI Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 10

***** CONSIGNACION *****

SITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
TE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	353915365	20/10/2010	15,442,000.00

***** CONCEPTO *****

RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	416,000.00
	TOTAL :	\$ 416,000.00

CUATROCIENTOS DIEZ Y SEIS MIL PESOS

ONSABLE :

BO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
ITUIDA POR NINGUN RECIBO.

3

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

BO OFICIAL DE CAJA : 10 - 88,396
A : OCTUBRE 20 DE 2010

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-084485-00002-0000

Fecha: 2010-10-20 16:39:34 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 444 RESPUESTAREQUE Folios: 10

***** CONSIGNACION *****

SITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
TE RAISBEK	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	353915365	20/10/2010	15,442,000.00

***** CONCEPTO *****

RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-03 CAMBIO DE MODALIDAD Y MODIFICA	12 MARCAS Y LEMAS COMERCIALES	114,000.00
	TOTAL :	\$ 114,000.00

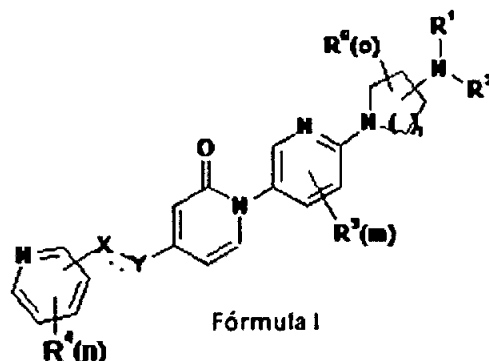
CIENTO CATORCE MIL PESOS

ONSABLE :

BO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

CAPITULO REIVINDICATORIO MODIFICADO
(Examen de Forma)

1. Un compuesto de Fórmula I,



o sal del mismo, en donde:

X y Y se seleccionan independientemente del grupo que consiste de -O-, -CH₂-, y =CH-, con la condición de que X y Y no son ambos -O-; -- es opcionalmente un enlace para formar un enlace doble;

R¹ se selecciona del grupo que consiste de

- (i) hidrógeno;
- (ii) alquilo de C₁₋₆ de cadena recta o ramificada, sustituido o no sustituido; y
- (iii) cicloalquilo de C₃₋₆ sustituido o no sustituido;

R² se selecciona del grupo que consiste de

- (i) hidrógeno;
- (ii) alquilo de C₁₋₆ de cadena recta o ramificada, sustituido o no sustituido;
- (iii) -C(O)NH₂;
- (iv) -C(O)R⁵;
- (v) -SO₂R⁵; y
- (vi) C(O)OR¹;

o R¹ y R² junto con el nitrógeno al que están unidos forman un heterociclo, y dicho heterociclo está opcionalmente sustituido con uno, dos, o tres grupos R⁵;

en donde cada R⁵ se selecciona independientemente del grupo que consiste de

- (i) hidroxí;
- (ii) alcoxi de C₁₋₃ no sustituido o sustituido;
- (iii) alquilo de C₁₋₆, de cadena recta o ramificada, no sustituido o sustituido; y
- (iv) cicloalquilo de C₃₋₆, no sustituido o sustituido; cada R³ y R⁴ se

CH₂CH₃, isopropilo, n-buto, isobuto, n-pentilo, isopentilo, n-hexilo, isohexilo, pirrolidinilo, N-morfolinilo, y acetilo;

R⁶ se selecciona del grupo que consiste de

- (i) hidrógeno;
- (ii) alquilo de C₁₋₆ de cadena recta o ramificada, sustituido o no sustituido; y
- (iii) cicloalquilo de C₃₋₆ sustituido o no sustituido;

l es 0, 1, o 2;

m es 0, 1, 2, o 3;

n es 0, 1, 2, o 3; y

o es 0, 1, 2, o 3.

2. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 1 o sal del mismo, caracterizado además porque X y Y están unidos por un enlace sencillo.

3. El compuesto de conformidad con las Reivindicaciones 1-2 o sal del mismo, caracterizado además porque R¹ se selecciona del grupo que consiste de alquilo de C₁₋₆ sustituido o no sustituido y cicloalquilo de C₃₋₆ sustituido o no sustituido, y R² es H.

4. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 3 o sal del mismo, caracterizado además porque R¹ es un alquilo de C₁₋₆ sustituido o un cicloalquilo de C₃₋₆ sustituido.

5. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 4 o sal del mismo, caracterizado además porque dicho alquilo de C₁₋₆ sustituido o cicloalquilo de C₃₋₆ sustituido está sustituido con 1 a 6 átomos de flúor.

6. El compuesto de conformidad con las Reivindicaciones 1-5 o sal del mismo, caracterizado además porque R² es un alquilo de C₁₋₆ sustituido.

7. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 6 o sal del mismo, caracterizado además porque dicho alquilo de C₁₋₆ está sustituido con 1 a 6 átomos de flúor.

8. El compuesto de conformidad con las Reivindicaciones 1-7 o sal, caracterizado además porque R¹ y R² son cada uno metilo.

9. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 1 o sal del mismo, caracterizado además porque R¹ y R² están unidos junto con el nitrógeno al que están unidos para formar un grupo pirrolidinilo o un grupo morfolinilo.

10. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 1 o sal del mismo, caracterizado además porque R^1 y R^2 están unidos junto con el nitrógeno al que están unidos para formar un heterociclo sustituido o no sustituido.
11. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 10 o sal del mismo, caracterizado además porque dicho heterociclo está sustituido con uno a tres grupos R^5 .
12. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 11 o sal del mismo, caracterizado además porque dicho R^5 se selecciona del grupo que consiste de alcoxi de C_{1-3} sustituido, alquilo de C_{1-6} sustituido, y cicloalquilo de C_{3-6} sustituido.
13. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 12 o sal del mismo, caracterizado además porque dicho alcoxi de C_{1-3} sustituido, alquilo de C_{1-6} sustituido, y cicloalquilo de C_{3-6} sustituido está sustituido con 1 a 6 átomos de flúor.
14. El compuesto de conformidad con las Reivindicaciones 1-13 o sal del mismo, caracterizado además porque dicho l es 1 o 2.
15. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 14 o sal del mismo, caracterizado además porque dicho l es 1.
16. El compuesto de conformidad con las reivindicaciones 1-14 o sal del mismo, caracterizado además porque m es 0.
17. El compuesto de conformidad con las reivindicaciones 1-14 o sal del mismo, caracterizado además porque n es 0, 1, o 2.
18. El compuesto de conformidad con las reivindicaciones 1-14 o sal del mismo, caracterizado además porque o es 0, 1, o 2.
19. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 1 o sal del mismo, caracterizado además porque dicho compuesto se selecciona del grupo que consiste de
- 4- $\{[(5\text{-cloro-2-piridinil)metil}]\text{oxi}\}$ -6'-[3-(etilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;
- 4- $\{[(5\text{-cloro-2-piridinil)metil}]\text{oxi}\}$ -6'-[3-(metilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;
- 4- $\{[(5\text{-cloro-2-piridinil)metil}]\text{oxi}\}$ -6'-[3-(dimetilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(dimetilamino)-1-pirrolidinil]-5'-metil-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(propilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-[etil(metil)amino]-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-[metil(1-metiletil)amino]-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(ciclohexilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(ciclopentilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-{[2-(metiloxi)etil]amino}-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(tetrahidro-2H-piran-4-ilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-(1,3'-bipirrolidin-1'-il)-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(4-morfolinil)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(amino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(metoxycarbonilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[4-(N-metilamino)-1-piperidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(N-metilacetamido)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(N-metilamino)-4-metil-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[5-fluoro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(dimetilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;

4-[[2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(dimetilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona.

20. El compuesto de conformidad con la Reivindicación 19 o sal del mismo, caracterizado además porque dicho compuesto se selecciona del grupo que consiste de

8

4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(etilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-
bipiridin-2-ona;
4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(metilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-
bipiridin-2-ona;
4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(dimetilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-
bipiridin-2-ona;
4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(dimetilamino)-1-pirrolidinil]-5'-metil-2H-
1,3'-bipiridin-2-ona;
4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(propilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-
bipiridin-2-ona;
4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-[etil(metil)amino]-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-
bipiridin-2-ona;
4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-[metil(1-metiletil)amino]-1-pirrolidinil]-
2H-1,3'-bipiridin-2-ona;
4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(ciclohexilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-
bipiridin-2-ona;
4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(ciclopentilamino)-1-pirrolidinil]-2H-1,3'-
bipiridin-2-ona;
4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-{[2-(metiloxi)etil]amino}-1-pirrolidinil]-
2H-1,3'-bipiridin-2-ona;
4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-[3-(tetrahidro-2H-piran-4-ilamino)-1-
pirrolidinil]-2H-1,3'-bipiridin-2-ona;
4-[[5-cloro-2-piridinil)metil]oxi}-6'-(1,3'-bipirrolidin-1'-il)-2H-1,3'-bipiridin-2-
ona.

21. El compuesto de conformidad con las Reivindicaciones 1-20 o sal del mismo, o una composición farmacéutica del mismo en combinación con al menos otro fármaco anti-obesidad o fármaco anti-diabético.

22. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de las Reivindicaciones 1-20 o sal de la misma.

23. Una composición farmacéutica que comprende un compuesto de las Reivindicaciones 1-20 o sal de la misma y uno o más excipientes.

24. [ELIMINADA] ~~Un método de tratamiento que comprende la administración a un mamífero de una composición farmacéutica que comprende un compuesto de las reivindicaciones 1-20 o una sal farmacéuticamente aceptable del mismo.~~

~~excipiente, en donde dicho tratamiento es para obesidad, diabetes, hipertensión, depresión, ansiedad, adicción a las drogas, adicción a una sustancia, o una combinación de las mismas.~~

25. [ELIMINADA] ~~El método de conformidad con la Reivindicación 24, caracterizado además porque dicho tratamiento es para obesidad, diabetes, o ambos.~~

26. ~~El método de conformidad con la Reivindicación 24, caracterizado además porque dicho mamífero es un humano.~~

27. [ELIMINADA] ~~Un compuesto de las reivindicaciones 1-20 o sal del mismo para uso en terapia.~~

28. [ELIMINADA] ~~Un compuesto de las reivindicaciones 1-20 o sal del mismo para uso como una sustancia terapéutica activa.~~

29. [ELIMINADA] ~~El uso de un compuesto de las reivindicaciones 1-20 o sal del mismo en la elaboración de una medicina para uso en el tratamiento de la obesidad, diabetes, hipertensión, depresión, ansiedad, adicción a las drogas, adicción a una sustancia, o una combinación de las mismas.~~

30. [ELIMINADA] ~~El uso de la Reivindicación 29 en donde dicho tratamiento es para obesidad, diabetes, o ambas.~~

31. [ELIMINADA] ~~Un procedimiento para la elaboración de un compuesto de la Reivindicación 1 o sal del mismo que comprende reaccionar un intermediario de piridona sustituido (D) con el intermediario de 2-aminopiridina (E) para proveer 2-aminopiridina (F).~~

32. 24. [RENUMERADA] Un procedimiento para la elaboración de un compuesto de la Reivindicación 1 o sal del mismo que comprende los pasos de

(i) calentar las 2-halo-5-bromopiridinas sustituidas con 3-hidroxipirrolidina en la presencia de base para proveer intermediario de hidroxipirrolidina (G);

(ii) formar el intermediario de mesilato (H);

(iii) desplazar el grupo mesilato con amina sustituida para proveer el intermediario 2-aminopiridina sustituido (E); y

(iv) acoplamiento mediado por cobre del intermediario de la 2-aminopiridina sustituida (E) con el intermediario de la piridona sustituida (D) para proveer 2-aminopiridina-piridona (F).

33- 25. [RENUMERADA] Un procedimiento para la elaboración de un compuesto de la Reivindicación 1 o sal del mismo que comprende los pasos de

(i) tratar 2-halo-5-bromopiridina sustituida con piperidina, pirrolidina o azetidina sustituida en la presencia de base para proveer el intermediario aminopiridina sustituido (E); y

(ii) acoplamiento mediado por cobre del intermediario aminopiridina sustituido (E) con el intermediario piridona sustituido (D) para proveer 2-aminopiridina-piridona (F).

34- 26. [RENUMERADA] Un procedimiento para la elaboración de un compuesto de la Reivindicación 1 o sal del mismo que comprende los pasos de

(i) oxidar metilisonicotinato hasta su N-óxido;

(ii) tratar dicho N-óxido con anhídrido acético en metanol para proveer metil 2-oxo-1,2-dihidro-4-piridincarboxilato;

(iii) reducir el éster de piridincarboxilato con LiBH_4 seguido por protección del alcohol primario como el éter de TBDMS para proveer el intermediario (I);

(iv) acoplamiento mediado por cobre del intermediario de 2-aminopiridina (E) con el intermediario (I) para proveer el intermediario sustituido (J);

(v) remoción catalizada por ácido del grupo protegido por sililo del intermediario (J) seguido por sometimiento a una reacción de Mitsunobu con fenol sustituido para proveer 2-aminopiridina-piridona (F).
